

PCT

REC'D 16 DEC 2005

REC'D 29 DEC 2004

Re: INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE  
PATENTIERBARKEIT

PCT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet  
Document PCT/PTO 16 DEC 2005)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts Brt/V/1/03	WEITERES VORGEHEN		siehe Formblatt PCT/IPEA/416
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/003567	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 03.04.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 08.04.2003	
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07C217/62, A61K31/135, C07C213/10, A61P13/00			
Anmelder <b>SCHWARZ PHARMA AG</b>			

1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen
  - a.  (*an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt*) insgesamt 7 Blätter; dabei handelt es sich um
    - Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).
    - Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der Internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.
  - b.  (*nur an das Internationale Büro gesandt*)> insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
 

<input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I	Grundlage des Bescheids
<input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. II	Priorität
<input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. III	Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
<input type="checkbox"/> Feld Nr. IV	Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
<input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V	Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
<input type="checkbox"/> Feld Nr. VI	Bestimmte angeführte Unterlagen
<input type="checkbox"/> Feld Nr. VII	Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
<input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VIII	Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 28.10.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 21.12.2004
Name und Postanschrift der mit der Internationalen Prüfung beauftragten Behörde Europäisches Patentamt - Gitschner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Rufet, J Tel. +49 30 25901-332



# **INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/003567

## **Feld Nr. I Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:

internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))  
 Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)  
 internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)

2. Hinsichtlich der **Bestandteile\*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt*):

## **Beschreibung, Seiten**

1-50

**in der ursprünglich eingereichten Fassung**

## **Ansprüche, Nr.**

1-34

eingegangen am 02.11.2004 mit Schreiben vom 28.10.2004

## **Zeichnungen, Blätter**

1-4

**in der ursprünglich eingereichten Fassung**

- einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3.  Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

  - Beschreibung: Seite
  - Ansprüche: Nr.
  - Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

4.  Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigefügten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

  - Beschreibung: Seite
  - Ansprüche: Nr.
  - Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

\* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/003567

## Feld Nr. II Priorität

1.  Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da folgende angeforderte Unterlagen nicht innerhalb der vorgeschriebenen Frist eingereicht wurden:
  - Abschrift der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist (Regel 66.7(a)).
  - Übersetzung der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist (Regel 7(b)).
2.  Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da sich der Prioritätsanspruch als ungültig erwiesen hat (Regel 64.1). Für die Zwecke dieses Berichts gilt daher das obengenannte internationale Anmeldedatum als das maßgebliche Datum.
3. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

## Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:
    - die gesamte internationale Anmeldung,
    - Ansprüche Nr. 18, 19 (teilweise), 32, 34 (teilweise)
- Begründung:
- Die gesamte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*):
  - Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie bitte nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):
  - Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte.
  - Für die obengenannten Ansprüche Nr. 18, 19 (teilweise), 32 und 34 betr. die gewerbliche Anwendbarkeit wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.
  - Das Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll entspricht nicht dem in Anhang C zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard, weil
    - die schriftliche Form
      - nicht eingereicht wurde.
      - nicht dem Standard entspricht.
    - die computerlesbare Form
      - nicht eingereicht wurde.
      - nicht dem Standard entspricht.
  - Die Tabellen zum Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll, sofern sie nur in computerlesbarer Form vorliegen, entsprechen nicht den in Anhang C bis zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen technischen Anforderungen.
  - siehe Beiblatt für weitere Angaben.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT  
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/003567

**Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung  
Neuheit (N) Ja: Ansprüche 7-15,17,19,21-27,33  
Nein: Ansprüche 1-6,16,20,28-31,34  
Erfinderische Tätigkeit (IS) Ja: Ansprüche 7-15,17,19,21-27,33  
Nein: Ansprüche 1-6,16,20,28-31,34  
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) Ja: Ansprüche: 1-17,19-31,33  
Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

**siehe Beiblatt**

**Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung**

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:  
**siehe Beiblatt**

**Zu Punkt III.**

1. Anspruch 34 bezieht sich auf einen Gegenstand, der nach Auffassung dieser Behörde unter die Regel 67.1 (iv) PCT fällt. Daher wird über die gewerbliche Anwendbarkeit des Gegenstands dieses Anspruchs kein Gutachten erstellt (Artikel 34(4) a) (i) PCT).

2. Die geltenden Patentansprüche 18 und 19 (teilweise) sind auf ein Produkt gerichtet, das mittels folgendem Parameter definiert wird: P1: Stabilisierungsfaktor (ist mindestens 2).

Die Verwendung dieses Parameters muss im gegebenen Zusammenhang als Mangel an Klarheit im Sinne von Artikel 6 PCT erscheinen. Es ist unmöglich, den vom Anmelder gewählten Parameter mit dem zu vergleichen, was der Stand der Technik hierzu offenbart. Der Mangel an Klarheit ist der gestaltet, daß er eine sinnvolle vollständige Recherche unmöglich macht. Daher kann keine Prüfung durchgeführt werden. Anspruch 19 ist abhängig von Anspruch 18 und enthält ein zusätzliches Parameter. Die Recherche von Anspruch 19 wurde daher auf ein Produkt mit diesem Parameter beschränkt.

3. Der geltende Patentanspruch 32 bezieht sich auf eine Verwendung, charakterisiert durch eine erstrebenswerte Eigenschaft, nämlich eine Polymerschicht, die Fesoterodin mit einer Fluxrate von 3-15mg/Tag durch Humanhaut abgibt. Der Patentanspruch umfaßt daher alle Verwendungen, die diese Eigenschaft aufweisen, wohingegen die Patentanmeldung Stütze durch die Beschreibung im Sinne von Artikel 5 PCT nur für eine begrenzte Zahl solcher Produkte liefert. Im vorliegenden Fall fehlen dem Patentanspruch die entsprechende Stütze bzw. der Patentanmeldung die nötige Offenbarung in einem solchen Masse, daß eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich erscheint. Desungeachtet fehlt dem Patentanspruch auch die in Artikel 6 PCT geforderte Klarheit, nachdem in ihm versucht wird, diese Verwendung über das zu erstrebende Ergebnis zu definieren. Der Mangel an Klarheit ist der gestaltet, daß er eine sinnvolle vollständige Recherche unmöglich macht. Daher kann keine Prüfung durchgeführt werden.

**Zu Punkt V.**

1. Im vorliegenden Bescheid wird auf folgende Dokumente verwiesen:

D1: WO 99/58478 A

D2: WO 01/35957 A

D3: WO 00/12070 A

## 2. Neuheit

Die vorliegende Anmeldung erfüllt nicht die Erfordernisse des Artikels 33(1) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-6, 17, 21, 29-32 und 35 im Sinne von Artikel 33(2) PCT nicht neu ist.

Dokument D1 offenbart Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit einem **Reinheitsgrad von 90 bis 99%** (siehe Beispiel 3aa, insbesondere S. 60, Z. 13-15 und S. 62) und ihre Verwendung zur Behandlung von Inkontinenz (siehe Zusammenfassung sowie S. 35-36). Der Gegenstand der Ansprüche 1-6, 16, 20, 28-31 und 34 ist somit als nicht neu angesehen.

Das Verfahren gemäß Anspruch 7 ist aus D1 und D2 nicht zu entnehmen und ist daher als neu angesehen.

## 3 Erfinderische Tätigkeit

Der Anmeldung ist folgende, der Erfindung zugrunde liegende Aufgabe zu entnehmen (siehe Beschreibung Seite 3, Z. 29 bis S. 4, Z. 2): Es sollen hochreine freie Basen von 3,3-Diphenylpropylaminen der Formel (I), die zur transdermalen oder transmukosalen Anwendung geeignet sind, bereitgestellt werden.

Aus D1 sind hochreine freie Basen von 3,3-Diphenylpropylaminen, die für transdermale Anwendung geeignet sind, bereits offenbart und aus D2 (siehe S. 2-3 und 28-32) sind die kristallinen Salze der Formel (II) mit hoher Stabilität und Reinheit offenbart. Das Verfahren gemäß neuen Anspruch 7 ist aus der Lehre von D1 und D2 nicht zu entnehmen und wird daher als erfinderisch angesehen.

## Zu Punkt VIII

Der in dem Anspruch 7 benutzte Ausdruck "geeigneten Freisetzungssreagenz" ist vage und unklar und läßt den Leser über die Bedeutung des betreffenden technischen Merkmals (Freisetzungssreagenz) im Ungewissen. Dies hat zur Folge, daß die Definition des Gegenstands dieses Anspruchs nicht klar ist (Artikel 6 PCT).

Das Freisetzungssreagenz sollte gemäß Anspruch 8 präzisiert werden.

Darüber hinaus kann ein unklarer Begriff nicht benutzt werden, wenn dieser Begriff für die Abgrenzung der Erfindung vom Stande der Technik hinsichtlich Neuheit und erfinderischer Tätigkeit wesentlich ist, was hier der Fall ist.

**Ansprüche**

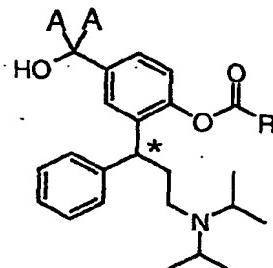
1. Eine Verbindung der allgemeinen Formel I,

5

**EPO - DG 1**

02. 11. 2004

(46)



Formel I

10

wobei A Deuterium oder Wasserstoff ist, R für eine Gruppe steht, die ausgewählt ist aus C<sub>1-6</sub> Alkyl, C<sub>3-10</sub> Cycloalkyl oder Phenyl, die jeweils mit C<sub>1-3</sub> Alkoxy, Fluor, Clor, Brom, Iod,

15 Nitro, Amino, Hydroxy, Oxo, Mercapto oder Deuterium substituiert sein kann und wobei das mit „\*“ (Stern) markierte C-Atom in (R)-Konfiguration, in (S)-Konfiguration oder als Mischung davon vorliegen kann,

dadurch charakterisiert, dass die besagte Verbindung als freie Base mit einem  
20 Reinheitsgrad von über 97 Gew% vorliegt.

2. Verbindung nach Anspruch 1, wobei R ausgewählt ist aus der Gruppe Methyl, Ethyl, iso-Propyl, 1-Propyl, 1-Butyl, 2-Butyl, tert.-Butyl, iso-Butyl, Pentyl und Hexyl.

25 3. Verbindung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die Verbindung 2-[3-(1,1-Diisopropylamino)-1-phenylpropyl]-4-(hydroxymethyl)phenyl isobutyrat ist.

4. Verbindung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass das mit „\*“ markierte C-Atom in (R)-Konfiguration vorliegt.

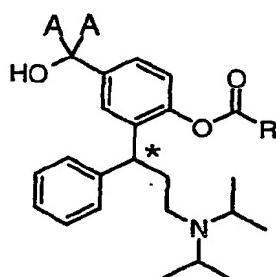
5. Verbindung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die Verbindung (R) 2-[3-(1,1-Diisopropylamino)-1-phenylpropyl]-4-(hydroxymethyl)phenyl isobutyrat (Fesoterodine) ist.

5

6. Verbindung nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Verwendung als Arzneimittel.

7. Herstellung einer Verbindung der allgemeinen Formel I

10



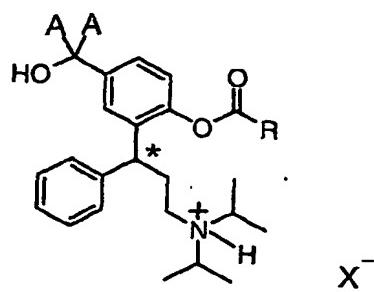
Formel I

wobei A für Deuterium oder Wasserstoff, R für eine Gruppe steht, die ausgewählt ist aus

15 C<sub>1-6</sub> Alkyl, C<sub>3-10</sub> Cycloalkyl oder Phenyl steht, die jeweils mit C<sub>1-3</sub> Alkoxy, Fluor, Clor, Brom, Iod, Nitro, Amino, Hydroxy, Oxo, Mercapto oder Deuterium substituiert sein kann und wobei das mit „\*“ (Stern) markierte C-Atom in (R)-Konfiguration, in (S)-Konfiguration oder als Mischung davon vorliegen kann, als freie Base in einer Reinheit von wenigstens 97 Gew%,

20

durch Freisetzung der Base aus einem kristallinen Salz der allgemeinen Formel II



Formel II

- mit einem Reinheitsgrad von wenigstens 97 Gew% wobei A und R die oben angegebene Bedeutung haben und X' der Säurerest einer physiologisch verträglichen Säure ist, und
- 5 wobei das mit „\*“ (Stern) markierte C-Atom in (R)-Konfiguration, in (S)-Konfiguration oder als Mischung davon vorliegen kann,
- dadurch gekennzeichnet, dass die Umsetzung der Verbindung der Formel II mit einem geeigneten Freisetzungsmittel in wässriger Lösung erfolgt, wobei das
- 10 Freisetzungsmittel einen  $pK_b$  von 8 – 11 hat und nicht zur Präzipitation der Verbindungen der Formel I führt.
8. Herstellungsverfahren nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass die freie Base der allgemeinen Formel I aus dem kristallinen Salz der allgemeinen Formel II freigesetzt wird, indem ein Freisetzungsmittel zugesetzt wird, wie in Anspruch 7 definiert und das ausgewählt ist aus der Gruppe
- (a) der Alkali-, Erdalkali- oder Ammonium-Hydrogencarbonate
- (b) der Amine, Polyamine und basischen Polyaminosäuren und
- 15 (c) der basischen Ionentauscher.
9. Herstellungsverfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass die Verbindung der Formel I aus einem kristallinen Salz der Formel II durch Zugabe eines Alkali-, Erdalkali- oder Ammonium-Hydrogencarbonats freigesetzt wird.
- 20
- 25
10. Herstellungsverfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass nach der Freisetzung der hochreinen Base der Formel I aus dem Salz der Formel II die wässrige Lösung mit einem organischen Lösemittel ausgeschüttelt wird und die hochreine Base der allgemeinen Formel I sodann durch Einengen der organischen Phase gewonnen wird.
- 30
11. Herstellungsverfahren nach Anspruch 10, wobei das organische Lösemittel ausgewählt ist aus der Gruppe Dichlormethan, Ethylmethylketon, Ethylacetat, tertiärer Butylmethylether, Diethylether sowie Toluol.
- 35

12. Herstellungsverfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass R ausgewählt ist aus der Gruppe Methyl, Ethyl, iso-Propyl, 1-Propyl, 1-Butyl, 2-Butyl, tert.-Butyl-, iso-Butyl, Pentyl und Hexyl und wobei das mit „\*“ (Stern) gekennzeichnete C-Atom in (R)-Konfiguration vorliegt.
- 5 13. Herstellungsverfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die Verbindung der Formel I (R)-2-[3-(1,1-Diisopropylamino)-1-phenylpropyl]-4-(hydroxymethyl)phenyl isobutyrat ist.
- 10 14. Herstellungsverfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die Verbindung der Formel II (R)-2-[3-(1,1-Diisopropylammonio)-1-phenylpropyl]-4-(hydroxymethyl)phenyl isobutyrat hydrogenfumarat ist.
- 15 15. Herstellung einer pharmazeutischen Formulierung umfassend eine Verbindung nach einem der Ansprüche 1-5, dadurch gekennzeichnet, dass besagte Verbindung nach einem Verfahren gemäß einem der Ansprüche 7-14 hergestellt wird und sodann mit einem pharmazeutisch akzeptablen Träger gemischt wird.
- 20 16. Pharmazeutische Formulierung enthaltend eine Verbindung nach einem der Ansprüche 1-5 und einen pharmazeutisch akzeptablen Träger.
17. Pharmazeutische Formulierung nach Anspruch 16, wobei der pharmazeutisch akzeptable Träger ein Polymer ist.
- 25 18. Pharmazeutische Formulierung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, gekennzeichnet durch die Stabilisierung der Verbindung der Formel I in der pharmazeutischen Formulierung, wobei der Stabilisierungsfaktor, erhalten durch Division der durchschnittlichen monatlichen Gehaltsabnahme der Verbindung der Formel I bei Lagerung als Öl und in Abwesenheit des pharmazeutisch akzeptablen Trägers bei 5°C
- 30 durch die durchschnittliche monatliche Gehaltsabnahme der entsprechenden Verbindung der Formel I bei Lagerung in besagter pharmazeutischer Formulierung bei 5°C, mindestens 2 ist.
19. Pharmazeutische Formulierung nach einem der Ansprüche 16-18, wobei die
- 35 Formulierung einen pH-Wert von 3,0-6,0 aufweist

20. Pharmazeutische Formulierung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die pharmazeutische Formulierung zur transdermalen oder transmukosalen Verabreichung geeignet ist.

5

21. Pharmazeutische Formulierung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die pharmazeutische Formulierung eine Polymerschicht enthält, in der eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1-5 gelöst oder dispergiert ist.

10 22. Pharmazeutische Formulierung nach Anspruch 21, wobei die Polymerschicht einen Haftkleber enthält, der die Fixierung der pharmazeutischen Formulierung auf der Haut oder Schleimhaut des Patienten ermöglicht.

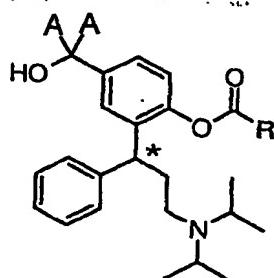
15 23. Pharmazeutische Formulierung nach Anspruch 21, wobei die Polymerschicht einen Haftkleber enthält, der die Fixierung der pharmazeutischen Formulierung auf der Haut des Patienten ermöglicht und der ausgewählt ist aus der Gruppe der Silikon-, Acrylat-, SXS-, PIB- oder EVA-basierten Haftkleber.

20 24. Pharmazeutische Formulierung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei die pharmazeutische Formulierung ein Transdermales Therapeutisches System vom Wirkstoff-in-Kleber Typ ist.

25. Kit, enthaltend eine pharmazeutische Formulierung nach einem der vorhergehenden Ansprüche und ein Trocknungsmittel:

25

26. Dosierungseinheit, die mindestens 3 mg einer Verbindung der allgemeinen Formel I,



Formel I

- sowie mindestens einen pharmazeutisch akzeptablen Trägerstoff enthält, wobei A Wasserstoff oder Deuterium ist, R für eine Gruppe steht, die ausgewählt ist aus C<sub>1-6</sub> Alkyl, C<sub>3-6</sub> Cycloalkyl oder Phenyl, die jeweils mit C<sub>1-3</sub> Alkoxy, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro,
- 5     Amino, Hydroxy, Oxo, Mercapto oder Deuterium substituiert sein kann und wobei das mit „\*“ (Stern) markierte C-Atom in (R)-Konfiguration, in (S)-Konfiguration oder als Mischung davon vorliegen kann, und wobei die freie Base der Verbindung I in einer Reinheit von über 97 Gew.-% vorliegt.
- 10    27. Dosierungseinheit nach Anspruch 26, wobei die Verbindung (R)-2-[3-(1,1-Diisopropylamino)-1-phenylpropyl]-4-(hydroxymethyl)phenyl isobutyrat (Fesoterodine) ist.
28. Verwendung einer Verbindung nach einem der Ansprüche 1-5 zur Herstellung eines Arzneimittels.
- 15    29. Verwendung nach Anspruch 28 wobei das Arzneimittel zur Behandlung von Inkontinenz, Hyperaktivität des Detrusors, Hyperaktivität der Blase, Pollakisurie, Nykturie oder imperativem Harndrang geeignet ist.
- 20    30. Verwendung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei das Arzneimittel zur transdermalen oder transmukosalen Verabreichung geeignet ist.
31. Verwendung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei das Arzneimittel ein Pflaster ist.
- 25    32. Verwendung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei das Arzneimittel
- (a) eine selbstklebende Polymerschicht umfasst, in die die hochreine Base von Fesoterodin eingebracht wurde und
  - (b) Fesoterodin mit einer Fluxrate von 3-15 mg/Tag durch Humanhaut abgibt.
- 30    33. Fesoterodin Hydrogencarbonat.

34. Methode zur Behandlung von Inkontinenz, Hyperaktivität des Detrusors, Hyperaktivität der Blase, Pollakisurie, Nykturie oder imperativem Harndrang, gekennzeichnet durch die Verabreichung einer Verbindung nach einem der Ansprüche 1-5 oder einer Formulierung  
5 nach einem der Ansprüche 16-24 an einen Säugер.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**